

WEST

Generate Collection

L8: Entry 7 of 8

File: DWPI

Nov 19, 1997

DERWENT-ACC-NO: 1988-096324
DERWENT-WEEK: 199751
COPYRIGHT 2001 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: Mouth cleaning compsn. - contg. extract of Zanthorylum
plant prepd. with mono:hydric alcohol

PATENT-ASSIGNEE:

ASSIGNEE

CODE

WAKUNAGASEIYAKU KK

WAKUN

PRIORITY-DATA: 1986JP-0190222 (August 13, 1986)

PATENT-FAMILY:

| PUB-NO | PUB-DATE | LANGUAGE | PAGES | MAIN-IPC |
|---------------|-------------------|----------|-------|------------|
| JP 2681081 B2 | November 19, 1997 | N/A | 005 | A61K007/26 |
| JP 63048208 A | February 29, 1988 | N/A | 006 | N/A |

APPLICATION-DATA:

| PUB-NO | APPL-DATE | APPL-NO | DESCRIPTOR |
|--------------|-----------------|----------------|----------------|
| JP 2681081B2 | August 13, 1986 | 1986JP-0190222 | N/A |
| JP 2681081B2 | | JP63048208 | Previous Publ. |

INT-CL (IPC): A61K 7/26

ABSTRACTED-PUB-NO: JP63048208A

BASIC-ABSTRACT:

A new mouth-cleaning compsn. contains a plant of Zanthorylum or its extract. Available plants include Zanthoxylum bungeanum Haxim., Haxim., Zanthoxylum piperitum DC., etc. the extract is typically prepd. with a 1-4C monohydric alcohol as extracting solvent.

USE - Provides a compsn. capable of use even when one has a toothache.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

TITLE-TERMS: MOUTH CLEAN COMPOSITION CONTAIN EXTRACT PLANT
PREPARATION MONO HYDRIC ALCOHOL

DERWENT-CLASS: D21

CPI-CODES: D08-B08;

SECONDARY-ACC-NO:

CPI Secondary Accession Numbers: C1988-043415

⑫ 公開特許公報(A)

昭63-48208

⑬ Int. Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和63年(1988)2月29日

A 61 K 7/26

6971-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全6頁)

⑮ 発明の名称 口腔洗浄用組成物

⑯ 特 願 昭61-190222

⑰ 出 願 昭61(1986)8月13日

⑱ 発 明 者 石 松 泰 彦 広島県高田郡甲田町下甲立1624 湧永製薬株式会社中央研究所内
 ⑲ 発 明 者 森 滝 祐 二 郎 広島県高田郡甲田町下甲立1624 湧永製薬株式会社中央研究所内
 ⑳ 発 明 者 藤 永 清 広島県高田郡甲田町下甲立1624 湧永製薬株式会社中央研究所内
 ㉑ 出 願 人 湧永製薬株式会社 大阪府大阪市福島区福島3丁目1番39号
 ㉒ 代 理 人 弁理士 佐藤 一雄 外2名

明 細 書

1. 発明の名称

口腔洗浄用組成物

2. 特許請求の範囲

1. サンショウ属(*Zanthoxylum* 属)植物またはこれらより得られる抽出物を含有してなることを特徴とする口腔洗浄用組成物。

3. 発明の詳細な説明

(発明の背景)

技術分野

本発明は、口腔洗浄用組成物に関する。さらに具体的には、本発明は、サンショウ属植物またはこれらより得られる抽出物を含有してなることを特徴とする口腔洗浄用組成物に関するものである。

先行技術

サンショウ属(*Zanthoxylum*)植物に属する花椒(*Zanthoxylum bungeanum* Maxim.)は、高さ3～

6 mの低木あるいは小高木であって、中国では大部分の地域に分布する。日本産の花椒は、実際にはサンショウ(*Zanthoxylum piperitum* De Candolle)であって、中国では産生しない(上海科学技術出版社編「中薬大辞典」、第1巻、第279～282頁((株)小学館発行(1985年12月10日))。この植物(花椒)は、根、葉、種子、茎、果皮、外皮等あるゆる部分が薬材となり得て、種々の薬理作用が知られている。例えば、歯茎が腫れて歯が動くのを治したり、歯痛を除くというような作用が知られている。そして、このような歯痛の治療の処方例として、花椒を酢で煎じて口に含むという処方や、種子を除いた花椒についてふるいにかけて粉末にし、上質の白い小麦粉で丸剤にし、焼いて熱くし、痛む箇所にかむという処方が知られている(前掲書、第1巻、第279～282頁)。

一方、歯の病気として、むし歯、歯根膜炎、歯槽膿漏、歯肉炎等が知られている。そしてこれら病気の予防としては、口内を掃除して常に清潔に

しておくというのが基本的な方法である。このため、歯磨や口内洗浄剤、口内洗浄液等が用いられている。しかしながら、歯痛が激しい場合には歯磨や口内洗浄剤等が使用できないことがある。従ってこのような場合においても使用し得るような歯磨、口内洗浄剤、口内洗浄液等の開発が望まれているところである。

(発明の概要)

要 旨

本発明は、上記問題点を解決することを目的とし、従来の歯磨、口内洗浄剤、口内洗浄液等の口腔洗浄用組成物にサンショウ属植物またはこれらより得られた成分を含有させることによってこの目的を達成しようとするものである。

従って本発明による口腔洗浄用組成物は、サンショウ属(*Zanthoxylum* 属)植物またはこれらより得られる抽出物を含有してなること、を特徴とするものである。

効 果

本発明の口腔洗浄用組成物は、上記サンショウ

属植物またはそれらより得られる抽出物を含有してなるものである。このサンショウ属植物には、中枢麻痺成分が含まれていて、これをたとえば摂取すると延髄を興奮させ、痙攣を起こすことが知られている。従って、これを含む口腔洗浄用組成物を使用するにあたり、痛みを感じることなく、あるいは痛みが軽減された状態での使用が可能である。

(発明の具体的な説明)

サンショウ属(*Zanthoxylum* 属)植物

本発明におけるサンショウ属(*Zanthoxylum* 属)植物は、ミカン科サンショウ属に属する植物であれば何でもよく、例えば花椒(*Zanthoxylum bungeanum* Maxim.)、山椒(*Zanthoxylum piperitum* DC.)、冬山椒(*Zanthoxylum planispinum* Sieb. et Zucc.)、烏の山椒(*Zanthoxylum ailanthoides* Sieb. et Zucc.)、犬山椒(*Zanthoxylum schinifolium* Sieb. et Zucc.)等(誠文堂新光社発行 伊沢凡人著「原色版日本薬用植物事典」p238~243(1981年4月15日発行)、

- 3 -

及び前掲書、第1巻、第279~282参照)任意のものを用いることができる。

これらのうちの好ましい具体例は、後記実施例に示すように花椒または山椒である。

花椒は中国全土に分布する低木あるいは小喬木(高さ3~6m)植物で、開花期が3~5月、結実期が7~10月で、果実は赤色ないし紫赤色で一面にこぶし状に突起した腺点が見られ、中の種子は1個で黒色を呈している。花椒の異名としては、キ、ダイショウ(大椒)、シンショウ(桑椒)、シクショウ(蜀椒)、ナンショウ(南椒)、ハショウ(巴椒)、トウト、カンショウ(漢椒)、センショウ(川椒)あるいはテンショウ(点椒)等がある(前掲中薬大辞典)が、本発明における「花椒」はこれらの異名を総称するものとする。一方、山椒は日本全土に分布する前記花椒と同様な形態、生態を有する低木あるいは小喬木植物で、詳細に関しては、日本薬局方解説書(第10改正)0.1.1, PD378~382(1981)広川書店刊を参照することができる。

- 5 -

- 4 -

これらのサンショウ属植物から本発明における口腔洗浄用組成物の薬材(有効成分となりうる部分)を取得する場合に、材料となる部分は上記植物の根、葉、種子、果皮または樹皮等任意の部分でありうるが、とりわけ果皮部が好ましい。採取したものは、乾燥するかそのままの状態、薬材として利用することができる。

従って、本発明において、イ)サンショウ属植物体をそのまま使用する場合は、上記薬材となり得る植物部分を適宜粉碎し、調製して口腔洗浄用組成物とすることができるが、好ましくは、果皮部分を乾燥して、できるだけ微粉末状に粉碎したものを使用することができる。ロ)一方、サンショウ属植物より抽出された成分を使用する場合は、植物体より有効成分を抽出する際の常法に従って調製したものを使用することができる。例えば、花椒またはその他同属植物を脱脂せずにあるいは通常の脂溶性有機溶媒を用いて脱脂してから、水または低級脂肪族アルコール(好ましくはC₁~

- 6 -

C₄-価アルコール)あるいは水と低級脂肪族アルコールとの混合物を抽剤としてその有効成分の抽出を行なう目的成分を得ることができる。抽剤としては、これらの外に、クロロホルム、アセトン、エーテル、ヘキサン、ジクロロメタン、ベンゼン等、任意の極性または非極性の有機溶媒を使用することができる。好ましくは、後記実施例に示すように果皮部分を水または含水あるいは非含水の低級脂肪族アルコール、クロロホルム等の極性有機溶媒による抽出に付し、得られた成分を必要に応じて精製に付した後使用することができる。なお、抽出は、加温下、常温下あるいは低温下でも行なうことができ、また抽出効率を上げるために、対象植物体は破碎したものであることが好ましいのは言うまでもない。

口腔洗浄用組成物

本発明口腔洗浄用組成物は、上記したサンショウ属植物あるいはこれらより得られる抽出物に、適宜、研磨剤、粘結剤、粘潤剤、発泡剤、防腐剤、甘味料、香料あるいは着色剤等を配合し、常法に

従って歯磨剤(歯磨、粉歯磨、液歯磨等)、口腔洗浄剤類(液状清涼剤、固形状清涼剤等)等の任意の口腔組成物に調製することができる。

さらに、これら口腔洗浄用組成物の適用形態を調製するにあたり、他の有効成分、例えば、フッ化ナトリウム、塩化ナトリウム、ヒノキチオール、アルキルグリシン、ε-アミノカプロン酸、アズレン、ビタミン類、塩化リゾチーム、デキストラーゼ等の消炎酵素類等を配合することも可能である。

上記研磨剤の具体例としては、例えば水酸化アルミニウム、酸化アルミニウム、第二リン酸カルシウム、二水和及び無水炭酸カルシウム、結晶あるいは無結晶質シリカ、アルミノシリケート、ピロリン酸カルシウム、磷酸カルシウム、不溶性メタリン酸ナトリウム等を、粘結剤としては、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、カラゲナン、アルギン酸塩、ヒドロキシエチルセルロース等を、粘潤剤としてはポリエチレングリコール、ソルビトール、プロピ

- 7 -

レングリコール、グリセリン等を、発泡剤としては、ショ糖脂肪酸エステル、ソジウムラウリルサルフェート、ラウリルスルホン酸ナトリウム、N-ラウロイルザルコシン酸ナトリウム、N-アシルグルタミン酸塩、ラウリルジエタノールアマイド、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、水素添加ココナツ脂肪酸モノグリセリドモノ硫酸ナトリウム等を、防腐剤として、p-オキシ安息香酸エステル類、クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコール、塩化ベンジルコニウム、フェノール類、デヒドロ酢酸、ソルビン酸等を、甘味料としてステビオサイド、サッカリンナトリウム、アスパルテーム、グリチルリチン、ペリラルチン、ネオヘスペリジルジヒドロカルコン等を、あるいは香料としてペパーミント、スピアミント等の精油、メントール、オイゲノール、アニトール等、口腔洗浄用組成物に通常使用されているものを適宜組合せて配合することができる。

上記サンショウ属植物あるいはこれらより得ら

- 8 -

れる抽出物の好ましい配合量は、一般に口腔洗浄用組成物の全重量を100とした場合、0.2%~20%であるが、特に好ましくは0.5%~5%である。

なお本発明におけるサンショウ属植物あるいはこれらより得られる抽出物は、花椒(または山椒)の精油成分であるゲラニオールが、ラットに経口投与した場合のLD₅₀が4.8g/kg、ウサギに静脈注射した場合のLD₅₀が50g/kgであること(前掲「中薬大辞典」第1巻、第279~282頁参照)、また上記植物が民間薬的にあるいは食用に用いられていることより一般に低毒性である。

実 験 例

参考例(薬材の取得)

1) 乾燥後細切した花椒の果皮20gにエタノール300ccを加えて、室温下で5日間の抽出に付した。次いで、エタノール画分を分別し、残渣を40%エタノールで2回洗浄し、洗液を上記母液と合わせ、凍結乾燥を行なう。かっ色のオイ

- 9 -

- 41 -

- 10 -

ル状物質4.2gを得た。

2) 乾燥後細切した花椒の果実20gにメタノール300mlを加えて、水浴上で6時間還流を行なった。次いで、メタノール画分を汙別し、残査をメタノールで2回洗浄し、洗液を上記汙液と合わせて減圧濃縮して、かっ色のオイル状物質4.4gを得た。

3) 乾燥後細切した花椒の果皮10gにエーテル100mlを加えて、5日間冷浸を行なった。次いでエーテル画分を汉別し、残査をエーテルで2回洗浄した後、洗液を上記汉液と合わせて減圧濃縮して、かっ色のオイル状物質1.2gを得た。

4) 乾燥後細切した山椒の果皮20gに、クロロホルム200mlを加えて、水浴上で6時間還流を行なった。次いで、クロロホルム画分を汉別し、更に残査をクロロホルムで4時間還流し、汉液を上記汉液と合わせて減圧濃縮して、かっ色のオイル状物質4.8gを得た。

5) 花椒の果皮乾燥物30gに300mlの水を加えて6時間還流を行ない、汉取した後、残査を再

び水で4時間還流し、汉液を合わせた後、凍結乾燥を行なって、かっ色の粉末状物質7.5gを得た。

6) 乾燥した花椒の果皮5gを乳鉢に入れて微細に粉碎した後、100メッシュの篩で篩過した。

7) 乾燥した山椒の果皮5gを乳鉢に入れて微細に粉碎した後、100メッシュの篩で篩過した。

8) 乾燥した花椒の果皮220gを1リットルのクロロホルムで5日間冷浸した後、クロロホルム層を減圧濃縮して、50gの濃かっ色のオイル状物質50gを得た。

このオイル状物質50gについてシリカゲルクロマトグラフィー（溶出液クロロホルム：メタノール（30：1））にて精製を行なうことにより、7gのかっ色オイル状物質を得た。

- 11 -

実施例1（練歯磨）

| | | |
|---------------------|-------|---|
| 第二リン酸カルシウム | 50.0 | % |
| グリセリン | 20.0 | |
| カルボキシメチルセルロース | 1.0 | |
| ラウリル硫酸ナトリウム | 1.0 | |
| サッカリンナトリウム | 0.2 | |
| クロルヘキシジン | 0.01 | |
| 花椒抽出物 （エタノール抽出物） | 2.0 | |
| 水 | 残 | |
| | 100.0 | % |

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って練歯磨剤を調製した。

実施例2（練歯磨）

| | | |
|----------------------|-------|---|
| 第二リン酸カルシウム | 50.0 | % |
| グリセリン | 20.0 | |
| 塩化ナトリウム | 3.0 | |
| カラゲナン | 0.5 | |
| カルボキシメチルセルロース | 1.0 | |
| ラウリル硫酸ナトリウム | 1.0 | |
| ショ糖セノラウレート | 2.0 | |
| リッカリン | 0.1 | |
| 山椒抽出物 （クロロホルム抽出物） | 2.5 | |
| 水 | 残 | |
| | 100.0 | % |

- 13 -

- 12 -

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って練歯磨剤を調製した。

実施例3（練歯磨）

| | | |
|---------------|-------|---|
| ピロリン酸カルシウム | 40.0 | % |
| 無水ケイ酸 | 5.0 | |
| グリセリン | 20.0 | |
| ソルビット（70%水溶液） | 5.0 | |
| カルボキシメチルセルロース | 1.0 | |
| サッカリンナトリウム | 0.1 | |
| メチルパラベン | 0.05 | |
| ラウリル硫酸ナトリウム | 1.0 | |
| 花椒粉末（水抽出物） | 1.0 | |
| 水 | 残 | |
| | 100.0 | % |

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って練歯磨剤を調製した。

- 14 -

実施例4(粉歯磨)

| | |
|---------------------|--------|
| 第二リン酸カルシウム | 50.0% |
| 炭酸カルシウム | 30.0 |
| グリセリン | 10.0 |
| α-オレフィンスル フォネート | 1.0 |
| サッカリン | 0.1 |
| モノクルオロリン酸 ナトリウム | 0.1 |
| デキストラン | 0.5 |
| 山椒粉末(果皮部分 の乾燥粉末) | 1.5 |
| 水 | 残 |
| | 100.0% |

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って粉歯磨とした。

実施例5(口腔洗浄剤)

| | |
|------------------------|--------|
| エタノール | 20.0% |
| スベアミント | 1.0 |
| サッカリン | 0.1 |
| モノフルオロリン酸 ナトリウム | 0.1 |
| ラウリルジエタノール アמיד | 0.3 |
| クロルヘキシジン | 0.01 |
| 花 椒 抽 出 物 (エーテル抽出物) | 1.2 |
| 水 | 残 |
| | 100.0% |

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って口腔洗浄剤とした。

- 15 -

実施例6(歯肉マッサージクリーム)

| | |
|------------------------------------|-------|
| 白色ワセリン | 8.0% |
| プロピレングリコール | 4.0 |
| ステアリルアルコール | 8.0 |
| ポリエチレングリコール | 25.0 |
| グリセリン | 30.0 |
| サッカリン | 0.1 |
| エタノール | 3.0 |
| 花 椒 抽 出 物 (クロロホルム 抽出物のシリカゲル精製物) | 1.8 |
| ペパーミント | 1.0 |
| 水 | 残 |
| | 100.0 |

上記成分を上記割合に従って配合し、常法に従って歯肉マッサージクリームとした。

参考例(鎮痛作用の判定)

1) 虫 歯

(1) 実験方法

歯磨の際に虫歯により激痛を伴う成人男子(24才~38才)6名及び成人女子(21才~

- 16 -

23才)4名を選び、前記実施例1で調製した練歯磨剤と通常の歯ブラシを与えて歯磨を行なわせた。

歯磨開始後(練歯磨剤を口腔内に入れた後)、約2分してから鎮痛効果を下記の基準で判定した。

| | |
|-----------------|----|
| 痛みを感じず歯磨ができた人 | ++ |
| 痛みが和らぎ歯磨が継続できた人 | + |
| 歯磨が継続不可能であった人 | - |

(2) 実験結果

以上の結果は、下表に示した通りである。

被検者10名中7名が痛みが和らいで歯磨が継続可能となった。また、3名は、ほとんど痛みを感じず、通常に歯磨を行なうことができた。

| | | | | | | | | | | |
|------|---|---|----|---|----|---|---|---|----|----|
| 非検者 | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | 10 |
| 判定結果 | + | + | ++ | + | ++ | + | + | + | ++ | + |

2) 歯肉炎

(1) 実験方法

歯磨の際に歯肉炎により激痛を伴う成人男子2名(32~36才)及び成人女子3名(34~

- 17 -

- 43 -

- 18 -

40才)を選び、前記実施例6で調製した歯肉マッリージクリームを約1g与え、人指指で3分間マッサージした後、通常の歯磨及び歯ブラシを与えて、歯磨を行なわせた。その時の鎮痛効果を前記実施例7と同様に判定した。

(2) 実験結果

以上の結果は、下表に示した通りである。被検者5名中3名が痛みが和らいで、歯磨が継続可能となった。また2名は、ほとんど痛みを感じず、通常に歯磨を行なうことができた。

| 非 検 者 | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 |
|-------|----|---|----|----|---|
| 判定結果 | ++ | + | ++ | ++ | + |

出願人代理人 佐 藤 一 組